

КАЛИКС[4]РЕЗОРЦИН, ФУНКЦИОНАЛИЗИРОВАННЫЙ ИНДОЛИНЫМ ФРАГМЕНТОМ, И ЕГО БИОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ

Сайфутдинова М.Н., Гуревич П.А., Шаталова Н.И., Гаврилова Е.Л.,
Крутов И.А., Мушлайкина Л.А., Петрова А.В.

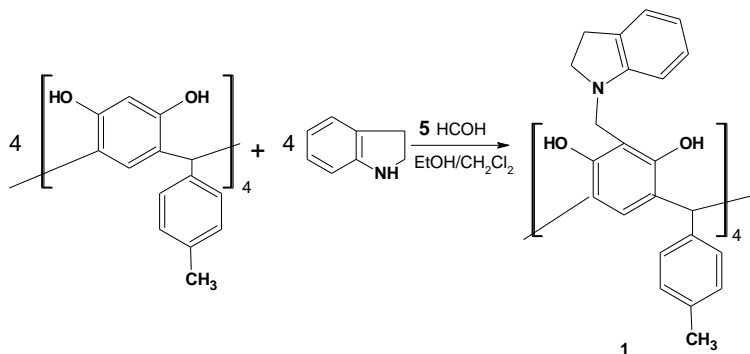
Казанский национальный исследовательский технологический
университет

420015, г. Казань, ул. К. Маркса, д. 68

Биохимический аспект индолина представляет определенный интерес, поскольку в живых организмах р-электроноизбыточная система пиррола участвует в процессах, связанных с передачей нервных импульсов и деятельностью центральной нервной системы. Производные индолина находят широкое применение в качестве ингибиторов СЕТР, активных ингредиентов в составе лекарственных средств для лечения эндометриозов, рака молочной железы, в качестве компонентов красок для волос, обладающих повышенной устойчивостью к действию факторов внешней среды.

Ранее нами было показано [1], что введение биологически активных молекул в структуру каликс[4]резорцинов (макроциклических тетрамеров, получаемых конденсацией резорцина с различными альдегидами) расширяет спектр их биологической активности.

Индолиновый фрагмент вводился в каликсареновую матрицу по реакции Манниха:



Полученное соединение было исследовано методами ЯМР ¹H, ЯМР ³¹P, ИК - спектроскопии, состав подтвержден данными элементного анализа. Расчет потенциальной биологической активности с помощью программы PASS показал, что каликс[4]резорцин, содержащий на верхнем «обода» молекулы фрагмент индолина,

проявляет биологическую активность в следующих областях: снятие дискинезии, зуда, усиление нейротрофического фактора, как антимикробное средство и т.д.

Соединение 1 прошло исследование антимикробной активности в Краснодарском научно-исследовательском ветеринарном институте РАСХН и показало следующие результаты:

Название	Культура микроорганизма, на которой проводилось испытание						
	Escherichia coli O ₁₅	Pseudomonas aeruginosa	Kluyvera cryocrescens	Enterobacter agglomerans	Proteus mirabilis	Streptococcus Gr E	Staphylococcus aureus
Соединение 1*	11	9	9	-	8	8	8
Левомитетин	22	18	21	24	15	25	26
Фуразолондон	26	16	18	15	19	23	20
Сульфадимезин	18	19	20	18	17	16	22

*Образцы исследовались в концентрации 2%.

1. Шаталова Н.И. и др. Каликс[4]резорцины, функционализированные аминокислотными остатками // ЖОХ. – 2009. – Т.79(141). Вып.7. - С.1137-1141.

РЕАКЦИОННАЯ СПОСОБНОСТЬ 6-R-5МЕТИЛ-7-ОН-1,2,4-ТРИАЗОЛО[1,5-A]ПИРИМИДИНОВ В РЕАКЦИИ НУКЛЕОФИЛЬНОГО ЗАМЕЩЕНИЯ

Саватеев К.В., Борисов С.С., Уломский Е.Н., Русинов В.Л.

Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

Хлордезоксигенирование триазолопиримидона (1) реализуется простым двухчасовым его кипячением в фосфорилхлориде. Продукт получается с выходом 67 %. Хлортриазолопиримидин (2) – стабильное соединение, устойчивое при хранении в обычных условиях, устойчивое к действию спиртов даже при кратковременном кипячении. Нагревание хлорпроизводного (2) с бутиламином в ДМФА приводит к образованию 7-бутиламино-1,2,4-триазоло[1,5-а]пиримидина (3) с удовлетворительным выходом.